

20/11
09/187848
Translation
16x1

B. Robinson 3 D 6

PATENT COOPERATION TREATY

RECEIVED

JUL 20 2001

PCT

TECH CENTER 1600/2900
10

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference 51630AWOM1XX	FOR FURTHER ACTION See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP99/07091	International filing date (day/month/year) 20 September 1999 (20.09.99)	Priority date (day/month/year) 24 September 1998 (24.09.98)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC C07D 221/16,		
Applicant SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT		

1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.	
2. This REPORT consists of a total of <u>6</u> sheets, including this cover sheet.	
<input type="checkbox"/>	This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).
These annexes consist of a total of _____ sheets.	
3. This report contains indications relating to the following items:	
I <input checked="" type="checkbox"/>	Basis of the report
II <input type="checkbox"/>	Priority
III <input type="checkbox"/>	Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
IV <input type="checkbox"/>	Lack of unity of invention
V <input checked="" type="checkbox"/>	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
VI <input checked="" type="checkbox"/>	Certain documents cited
VII <input checked="" type="checkbox"/>	Certain defects in the international application
VIII <input checked="" type="checkbox"/>	Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 24 March 2000 (24.03.00)	Date of completion of this report 09 October 2000 (09.10.2000)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP99/07091

I. Basis of the report

1. This report has been drawn on the basis of *(Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to the report since they do not contain amendments.)*:

- ☒ the international application as originally filed.
- ☒ the description, pages 1-29, as originally filed,
 pages _____, filed with the demand,
 pages _____, filed with the letter of _____,
 pages _____, filed with the letter of _____.
- ☒ the claims, Nos. 1-11, as originally filed,
 Nos. _____, as amended under Article 19,
 Nos. _____, filed with the demand,
 Nos. _____, filed with the letter of _____,
 Nos. _____, filed with the letter of _____.
- ☐ the drawings, sheets/fig _____, as originally filed,
 sheets/fig _____, filed with the demand,
 sheets/fig _____, filed with the letter of _____,
 sheets/fig _____, filed with the letter of _____.

2. The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages _____
- ☐ the claims, Nos. _____
- ☐ the drawings, sheets/fig _____

3. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

4. Additional observations, if necessary:

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/EP 99/07091

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Claims	1-11	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims		YES
	Claims	1-11	NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-11	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations

This report makes reference to the following documents:

D1: WO-A-96/14844 (MERCK & CO., INC.) 23 May 1996 (1996-05-23)

Novelty

The structural features by which the claimed compounds differ from the closest prior art are the bridge between the 3,4 position of the 3,4-dihydro-2-aminoquinoline and the R³ group, and the substitution of the aromatic ring by R⁴ (D1: Claim 1, page 234, for example).

Inventive step

3,4-dihydro-2-aminoquinolines substituted on the amino group were already disclosed in D1 (Examples 36-41, pages 82-84, for example). The structural feature that consists in the bridge of the 3,4 position by means of an O-isopropylidene group (R³ = -OC(CH₃)₂O-) is described in D1 for the structurally related 2-imino-piperidines (Example 100, page 140, for example).

Further, D1 presents data (Tables 4-8, pages 41-51, for

example) on *in vitro* effectiveness (NOS inhibition) for both the above-mentioned examples and for a large number of other, structurally closely related compounds.

Therefore it is obvious to a person skilled in the art to combine the structural features disclosed in D1 and to assume that compounds having this structure are very likely to have comparable pharmacological properties, as do the compounds described in D1.

The present application contains no data that has an unexpected effect or advantage over the structurally most similar compounds, which are disclosed in D1 (Examples 36-41, pages 82-84, for example).

In fact, there are no results at all of experiments (pertaining to NOS inhibition, for example) that suggest some sort of pharmacological effect. It is only mentioned in general terms that the claimed compounds can be used "particularly expediently as medicines", and this statement also fails to make it clear for which prior art this is the case.

Furthermore, the claimed groups of substances are only insufficiently supported by compounds that have actually been produced. For example, in the example compounds, groups R^1 and R^2 are always hydrogen, R^3 is always a saturated C_3 alkyl residue, $NR^{14}R^{15}$ is always a 3-chlorobenzyl amino or N-tert-butoxycarbonyl-3-chlorobenzyl amino group, and R^6 is always hydrogen.

For the above-mentioned reasons, inventive step as per PCT Article 33(3) cannot be acknowledged for Claims 1 to 11.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/EP 99/07091

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: VI

Reference is made to the following "P" document:

D2: WO-A-99/41240 (SCHERING AG) 19 August 1999
(1999-08-19)

This document could become relevant for a later
evaluation according to the EPO.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/EP 99/07091

VII. Certain defects in the international application

The following defects in the form or contents of the international application have been noted:

The above-mentioned prior art is not cited in the description (PCT Rule 5.1(a)(ii)).

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP 99/07091

VIII. Certain observations on the international application

The following observations on the clarity of the claims, description, and drawings or on the question whether the claims are fully supported by the description, are made:

In Claims 10 and 11, the definition of the group R^3 by the wording "the above meaning" is not clear without a reference to Claim 1 or 3 (PCT Article 6).

PCT

WORLD INTELLECTUAL PROPERTY ORGANIZATION

International Office

INTERNATIONAL APPLICATION PUBLISHED ACCORDING TO THE PATENT
COOPERATION TREATY (PCT)

(51) International patent classification⁷: C07D 221/16, A61K
31/435, C07D 405/04, 221/18 A1

(11) International publication number: WO 00/17167

(43) International publication date: March 30, 2000 (3/30/00)

(21) International file number: PCT/EP99/07091

(22) International application date: September 20, 1999 (9/20/99)

(30) Priority data: 198 45 830.4 September 24, 1998 (9/24/98) DE

(71) Applicant (for all designated countries except the U.S.):

SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; Müllerstrasse 178, D-
13353 Berlin (DE).

(72) Inventors; and

(75) Inventors/applicants (only for the U.S.):

JARACH, Stefan [DE/DE]; Schlüterstrasse 65, D-10625 Berlin
(DE). REHWINKEL, Hartmut [DE/DE]; Glasower Strasse 41, D-
12051 Berlin (DE). HÖLSCHER, Peter [DE/DE]; Rathenower
Strasse 52, D-10559 Berlin (DE). SÜLZLE, Detlev [DE/DE];
Scheinerweg 4, D-10589 Berlin (DE). HILLMANN, Margrit
[DE/DE]; Grünlandweg 3A, D-13437 Berlin (DE). BURTON,
Gerardine, Anne [GB/DE]; Seegfelder Weg 235, D-13591 Berlin
(DE). MCDONALD, Fiona, Mcdougall [GB/DE]; Mohrunger Allee
6B, D-14055 Berlin (DE).

(74) Joint representative: SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT;

Müllerstrasse 178, D-13353 Berlin (DE).

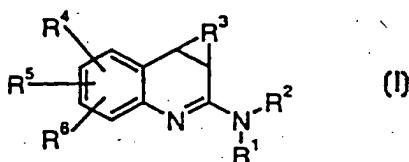
(81) Designated countries: AE, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DK, DM, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), Eurasian Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), European Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Published:

With international search report.

Before expiration of the time limit allowed for amendment of the claims. It will be republished if amendments are made.

(54) Title: AMINOALKYL-3,4-DIHYDROQUINOLINE DERIVATIVES AS NO-SYNTASE INHIBITORS



(57) Abstract

Compounds of formula (I), their tautomeric and isomeric forms and salts, as well as the process for their production and their use in pharmaceutical agents are described.

FOR INFORMATION ONLY

Codes used for identifying PCT member countries on the head sheets of the publications of international applications according to the PCT.

AL	Albania
AM	Armenia
AT	Austria
AU	Australia
AZ	Azerbaijan
BA	Bosnia-Herzegovina
BB	Barbados
BE	Belgium
BF	Burkina Faso
BG	Bulgaria
BJ	Benin
BR	Brazil
BY	Belarus
CA	Canada
CF	Central African Republic
CG	Congo
CH	Switzerland
CI	Ivory Coast
CM	Cameroon
CN	China
CU	Cuba
CZ	The Czech Republic
DE	Germany
DK	Denmark
EE	Estonia
ES	Spain
FI	Finland
FR	France
GA	Gabon
GB	United Kingdom
GE	Georgia
GH	Ghana
GN	Guinea
GR	Greece
HU	Hungary
IE	Ireland
IL	Israel
IS	Iceland
IT	Italy
JP	Japan
KE	Kenya
KG	Kyrgyzstan
KP	Democratic People's Republic of Korea
KR	Republic of Korea
KZ	Kazakhstan

LC St. Lucia
LI Liechtenstein
LK Sri Lanka
LR Liberia

LS Lesotho
LT Lithuania
LU Luxembourg
LV Latvia
MC Monaco
MD Republic of Moldova
MG Madagascar
MK the former Yugoslavian Republic of Macedonia
ML Mali
MN Mongolia
MR Mauritania
MW Malawi
MX Mexico
NE Niger
NL The Netherlands
NO Norway
NZ New Zealand
PL Poland
PT Portugal
RO Romania
RU Russian Federation
SD Sudan
SE Sweden
SG Singapore

SI Slovenia
SK Slovakian Republic
SN Senegal
SZ Swaziland
TD Chad
TG Togo
TJ Tajikistan
TM Turkmenistan
TR Turkey
TT Trinidad and Tobago
UA The Ukraine
UG Uganda
US United States of America
UZ Uzbekistan
VN Vietnam
YU Yugoslavia
ZW Zimbabwe

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

PCT

REC'D 11 OCT 2000

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 51630AWOM1XXXXOO-P	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsbericht (Formblatt PCT/IPEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP99/07091	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 20/09/1999	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Tag) 24/09/1998
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK C07D221/16		
Anmelder SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT et al.		



- Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationale vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
- Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 6 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.

☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor der Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

 Diese Anlagen umfassen insgesamt Blätter.

- Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Berichts
- II ☐ Priorität
- III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☒ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☒ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☒ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags 24/03/2000	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 09.10.2000
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde:  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. +49 89 2399 - 0 Tx: 523656 epmu d Fax: +49 89 2399 - 4465	Bevollmächtigter Bediensteter Cortés, J Tel. Nr. +49 89 2399 8206 

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

Internationales Aktenzeichen PCT/EP99/07091

I. Grundlage des Berichts

1. Dieser Bericht wurde erstellt auf der Grundlage (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten.*):

Beschreibung, Seiten:

1-29 ursprüngliche Fassung

Patentansprüche, Nr.:

1-11 ursprüngliche Fassung

2. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- | | |
|--|---------|
| <input type="checkbox"/> Beschreibung, | Seiten: |
| <input type="checkbox"/> Ansprüche, | Nr.: |
| <input type="checkbox"/> Zeichnungen, | Blatt: |

3. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)):

4. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung

Neuheit (N)	Ja: Ansprüche 1-11
	Nein: Ansprüche
Erfinderische Tätigkeit (ET)	Ja: Ansprüche
	Nein: Ansprüche 1-11
Gewerbliche Anwendbarkeit (GA)	Ja: Ansprüche 1-11
	Nein: Ansprüche

2. Unterlagen und Erklärungen

si h Beiblatt

VI. Bestimmte angeführte Unterlagen

1. Bestimmte veröffentlichte Unterlagen (Regel 70.10)
und / oder
2. Nicht-schriftliche Offenbarungen (Regel 70.9)
siehe Beiblatt

VII. Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung

Es wurde festgestellt, daß die internationale Anmeldung nach Form oder Inhalt folgende Mängel aufweist:
siehe Beiblatt

Zu Punkt V

Begründete Feststellung nach Regel 66.2(a)(ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

Es wird auf folgende Dokumente verwiesen:

D1: WO 96 14844 A (MERCK & CO., INC.) 23. Mai 1996 (1996-05-23)

Neuheit

Die strukturellen Merkmale, durch die sich die beanspruchten Verbindungen vom nächsten Stand des Wissens unterscheiden, ist die Überbrückung der 3,4-Position des 3,4-Dihydro-2-Aminochinolins mit der R³-Gruppe, sowie die Substitution des aromatischen Rings mit R⁴ (D1: z.B. Anspruch 1, Seite 234).

Erfinderische Tätigkeit

An der Aminogruppe substituierte 3,4-Dihydro-2-Aminochinoline wurden bereits in D1 offengelegt (z.B. Beispiele 36-41, Seiten 82-84). Das strukturelle Merkmal der Überbrückung der 3,4-Position durch eine O-Isopropylidengruppe (R³ = -OC(CH₃)₂O-) ist in D1 für die strukturell verwandten 2-Imino-Piperidine beschrieben (z.B. Beispiel 100, Seite 140).

Ferner werden in D1, sowohl für die o.g. Beispielverbindungen als auch für eine Vielzahl weiterer, strukturell eng verwandter Verbindungen, Daten zur in-vitro Wirksamkeit (NOS-Hemmung) vorgelegt (z.B. Tabellen 4-8, Seiten 41-51).

Es ist daher für den Fachmann naheliegend, die in D1 offenbarten Strukturmerkmale zu kombinieren und davon auszugehen, daß Verbindungen dieser Struktur mit großer Wahrscheinlichkeit vergleichbare pharmakologische Eigenschaften haben werden, wie die in D1 beschriebenen Verbindungen.

Im vorliegenden Antrag finden sich keine Daten, die einen unerwarteten Effekt oder Vorteil gegenüber den in D1 offenbarten, strukturell am nächsten verwandten Verbindungen (z.B. Beispiele 36-41, Seiten 82-84) belegen.

Tatsächlich werden überhaupt keine Ergebnisse von Untersuchungen vorgelegt (z.B. zur NOS-Hemmung), die irgendeinen pharmakologischen Effekt nahelegen. Es wird lediglich pauschal erwähnt, daß die beanspruchten Verbindungen "besonders vorteilhaft als Arzneimittel" verwendet werden können, dabei ist auch nicht ersichtlich gegenüber welchem Stand der Technik dies der Fall sein soll.

Desweiteren werden die beanspruchten Substanzgruppen nur unzureichend durch tatsächlich hergestellte Verbindungen gestützt. So sind z.B. die Gruppen R^1 und R^2 in den exemplarischen Verbindungen immer Wasserstoff, R^3 immer ein gesättigter C_3 -Alkylrest, $NR^{14}R^{15}$ immer eine 3-Chlorbenzylamino oder eine N-tert-Butoxycarbonyl-3-Chlorbenzylamino-Gruppe und R^6 immer Wasserstoff.

Aus diesen Gründen kann eine erfinderische Tätigkeit nach Artikel 33(3) PCT für die Ansprüche 1 bis 11 nicht anerkannt werden.

Zu Punkt VI

Bestimmte angeführte Unterlagen

Es wird auf folgendes P-Dokument verwiesen:

D2: WO 99 41240 A (SCHERING AG) 19. August 1999 (1999-08-19)

Dieses Dokument könnte für eine spätere Feststellung nach dem EPÜ relevant werden.

Zu Punkt VII

Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung

Der o.g. Stand der Technik wird nicht in der Beschreibung zitiert (Regel 5.1(a)(ii) PCT).

Zu Punkt VIII

Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Die Definition der Gruppe R^3 durch die Formulierung "die obige Bedeutung" in den Ansprüchen 10 und 11 ist ohne Bezug auf Anspruch 1 oder 3 nicht eindeutig (Artikel 6 PCT).

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT
AUF DEM GEBIET DES PATENTWESSENS

PCT

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 51630AWOM1XX	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übermittlung des internationalen Recherchenberichts (Formblatt PCT/ISA/220) sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 99/07091	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 20/09/1999	(Frühestes) Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 24/09/1998
Anmelder SCHERING AKTIENGESELLSCHAFT et al.		

Dieser internationale Recherchenbericht wurde von der Internationalen Recherchenbehörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Internationalen Büro übermittelt.

Dieser internationale Recherchenbericht umfaßt insgesamt 2 Blätter.

☒ Darüber hinaus liegt ihm jeweils eine Kopie der in diesem Bericht genannten Unterlagen zum Stand der Technik bei.

1. Grundlage des Berichts

a. Hinsichtlich der **Sprache** ist die internationale Recherche auf der Grundlage der internationalen Anmeldung in der Sprache durchgeführt worden, in der sie eingereicht wurde, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

☐ Die internationale Recherche ist auf der Grundlage einer bei der Behörde eingereichten Übersetzung der internationalen Anmeldung (Regel 23.1 b)) durchgeführt worden.

b. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale Recherche auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das

☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.

☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.

☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.

☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.

☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.

☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfaßten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

2. ☐ Bestimmte Ansprüche haben sich als nicht recherchierbar erwiesen (siehe Feld I).

3. ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung (siehe Feld II).

4. Hinsichtlich der **Bezeichnung der Erfindung**

☐ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.

☒ wurde der Wortlaut von der Behörde wie folgt festgesetzt:

AMINOALKYL-3,4-DIHYDROCHINOLIN-DERIVATE ALS NO SYNTHASE INHIBITOREN

5. Hinsichtlich der **Zusammenfassung**

☒ wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.

☐ wurde der Wortlaut nach Regel 38.2b) in der in Feld III angegebenen Fassung von der Behörde festgesetzt. Der Anmelder kann der Behörde innerhalb eines Monats nach dem Datum der Absendung dieses internationalen Recherchenberichts eine Stellungnahme vorlegen.

6. Folgende Abbildung der **Zeichnungen** ist mit der Zusammenfassung zu veröffentlichen: Abb. Nr. —

☐ wie vom Anmelder vorgeschlagen

☐ weil der Anmelder selbst keine Abbildung vorgeschlagen hat.

☐ weil diese Abbildung die Erfindung besser kennzeichnet.

☐ keine der Abb.

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

T/EP 99/07091

A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 C07D221/16 A61K31/435 C07D405/04 C07D221/18

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 C07D A61K

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie°	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 96 14844 A (MERCK & CO., INC.) 23. Mai 1996 (1996-05-23) * Seite 1, 82-84 *	1,8
P, X	WO 99 41240 A (SCHERING AG) 19. August 1999 (1999-08-19) * das ganze Dokument *	1-4, 6-9, 11

☐ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

° Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

25. Januar 2000

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

02/02/2000

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchenbehörde
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL - 2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Van Bijlen, H

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 99/07091

Patent document cited in search report		Publication date	Patent family member(s)	Publication date
W0 9614844	A	23-05-1996	US 5629322 A	13-05-1997
			AU 702415 B	18-02-1999
			AU 4462496 A	06-06-1996
			EP 0789571 A	20-08-1997
			JP 10509150 T	08-09-1997
<hr/>				
W0 9941240	A	19-08-1999	DE 19806348 A	19-08-1999
			AU 2921199 A	30-08-1999
<hr/>				